

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 05-078222  
(43)Date of publication of application : 30.03.1993

(51)Int.Cl.

A61K 7/06  
A61K 35/78

(21)Application number : 03-100219

(71)Applicant : SANSHO SEIYAKU CO LTD

(22)Date of filing : 01.05.1991

(72)Inventor : TACHIBANA KUNIHARU

## (54) PREVENTIVE FOR GRAY HAIR

### (57)Abstract:

PURPOSE: To provide a preventive for gray hair having excellent effect on preventing the generation of gray hair without causing the damages such as eczema and rash of scalp and hair.

CONSTITUTION: The objective agent contains a water or ethanol extract of OUREN (rhizome of *Coptis japonica*) in an amount of 0.01-10wt.%, preferably 0.5-2.0wt.% in terms of berberine chloride in the agent. The extracted liquid has excellent safety to skin, exhibits a melanogenesis-promoting action and is usable in the form of cream, lotion, emulsion, ointment, liniment, etc.

## LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19)日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号

特開平5-78222

(43)公開日 平成5年(1993)3月30日

(51)Int.Cl. <sup>5</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 7/06		8615-4C		
35/78	ADA F	7180-4C		

審査請求 未請求 請求項の数1(全 4 頁)

(21)出願番号 特願平3-100219

(22)出願日 平成3年(1991)5月1日

(71)出願人 000176110

三省製薬株式会社

福岡県大野城市大池2丁目26番7号

(72)発明者 立花 國治

福岡県大野城市大字乙金107-77

(74)代理人 弁理士 庄子 幸男 (外1名)

(54)【発明の名称】 白髪防止剤

(57)【要約】

【構成】 オウレンの水またはエタノール抽出液を有効成分とすることを特徴とする白髪防止剤。

【効果】 本発明の有効成分は、安全性が高く、優れたメラニン生成亢進作用を有するため、これを配合した製剤を地肌に塗布すれば、頭皮や毛髪に湿疹やかぶれなどの障害を与えることなく、効果的に白髪の発生を防止することができる。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 オウレンの水またはエタノール抽出液を有効成分とすることを特徴とする白髪防止剤。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【産業上の利用分野】本発明は、地肌に塗布することによって白髪の発生を防止する白髪防止剤に関するものでより詳しくは、オウレンの抽出液を有効成分とする白髪防止剤に関するものである。

## 【0002】

【従来の技術】白髪は一般に年齢が高くなると頭髪のメラニンが減少あるいは消失して発生するもので、一方では白髪によってその人の年長による人柄の重厚さを与えるものであるが、他方では老齡の感を印象づけ、特に若年における白髪は一般に嫌われる。そのため、白髪を隠すため白髪染などにより白髪を黒く染める染色剤が多く研究され、また広く市場に使用されている。しかし、白髪染は一過性のものであり、白髪の成長によって再び染色しなければならず、また現在広く使用されている酸化型白髪染は、酸化剤などの使用によって皮膚や毛髪に障害を与える傾向がある。

【0003】したがって、白髪の発生を防止する白髪防止剤について種々の研究が行われている。

【0004】例えば、黒ゴマ、黒松の葉、昆布を用いたもの（特開昭56-87515号公報）、西洋がらし葉エキスをを用いたもの（特開昭56-79617号公報）、千振りの抽出液を用いたもの（特開昭59-70605号公報）、ウコギ抽出エキスをを用いたもの（特開昭60-178805号公報）、明日葉の抽出物を用いたもの（特開昭62-77307号公報）等の植物抽出物を有効成分とするものがある。また、脳下垂体ホルモンを用いたもの（特開昭62-63510号公報）、3-（3,4-ジヒドロキシフェニル）-L-アラニンを用いるもの（特開昭62-63509号公報）、C-AMP（アデノシン-3,5'-サイクリックホスフェイト）を用いるもの（特開昭62-45527号公報）、ビタミンD<sub>3</sub>を用いるもの（特開昭60-174705号公報）及びミノキシジルを用いるもの（特開昭61-165310号公報、同61-227518号公報）等が開示されている。

## 【0005】

【発明が解決しようとする課題】従来の白髪防止剤の有効成分は、主として植物、動物成分の抽出物又は動物の生体活動に関与する成分であり、原料入手が困難なためその製造に制約があったり、効果も不安定で充分とは言えないものであった。また、安全性にも問題があった。近年になって、染毛成分としてベルベリン系色素またはそれを含有するオウレンの抽出エキスを配合した染毛剤（特開平2-138114号公報）が開示されているが、オウレンに含まれるパルマチン、コブチシン、オウ

レン、フェロデンドリン、リモニン等によって黄色系に、さらにこれと鉄塩を併用することによって黄褐色に染毛できることが示されているだけで、メラニンの消失にともなう白髪の発生を防止するためのものではない。

【0006】そこで本発明の目的は、皮膚に対する安全性にすぐれ、メラニン生成亢進作用を有する物質を有効成分とする白髪防止剤を提供することにある。

## 【0007】

【課題を解決するための手段】毛髪におけるメラニンは毛髪の色調に関係する重要な因子の1つで、毛母上部に存在する色素細胞メラノサイト内において生成され、毛髪皮質細胞ケラチノサイトに取り込まれた後、毛の生長と共に上方に移動する。生理的老化の一現象として認められる白髪は、毛母メラノサイトの数的減少及びメラノサイトの機能低下によるメラニン生成の減少によって発症する。

【0008】本発明者は、白髪の発生現象並びにその機構について基礎研究を行い、培養色素細胞（B16メラノーマ細胞）を使った実験において、オウレンの水またはエタノール抽出液が色素細胞のメラニン生成を活性化することを見出し本発明を完成した。

【0009】すなわち本発明によれば、オウレンの水またはエタノール抽出液を有効成分とする白髪防止剤が提供される。

【0010】本発明の有効成分は、オウレンを水またはエタノールによって抽出した抽出液であり、とくにその中に含まれる塩化ベルベリンがすぐれたメラニン生成亢進作用を有する。

【0011】オウレン（*Coptis japonica Makino*）は、常緑の多年生草本で、わが国では主として福井、鳥取、新潟、石川、兵庫、高知の山間部で栽培され、健胃消化薬、止瀉薬、精神神経用薬などの漢方用処方薬として配合されており、オウレン中には、3~7%のベルベリンを含んでいる。本発明の白髪防止剤は、クリーム、ローション、乳剤、軟膏、リニメント等の医薬品、部外品、化粧品の製剤型にして用いられる。

【0012】本発明の白髪防止剤の有効成分であるオウレンの水またはエタノールによる抽出液は塩化ベルベリンとして0.01~10%（重量）、好ましくは0.5~2.0%（重量）を製剤中に含有する。

【0013】また、同有効成分は皮膚に対し何らの障害を与えるものではなく安全な物質である。

【0014】オウレンの水またはエタノールによる抽出液は、たとえば次のような方法によって得られる。

【0015】製造例1：オウレンのエタノール抽出液  
オウレンの微細粉末5gに、エタノール95mlを加えて室温で24時間攪拌し、抽出した。抽出後、遠心分離を行い（20分、3,000rpm）、上清液をとる。さらに、残渣についても同様の処理を2回行い、これら

の上清液を前記の上清液に合わせて粗抽出液とする。この粗抽出液を減圧濃縮後、ろ過して澄明なる液50mlを得た。

#### 【0016】製造例2

オウレンの細切れ粉末20gに、水380mlを加えて40℃に加温しながら24時間攪拌し、抽出した。抽出後、遠心分離を行い(20分、3,000rpm)、上清液をとる。さらに残渣についても同様の処理を3回行い、これらの上清液を前記の上清液に合わせて粗抽出液とする。この粗抽出液を減圧濃縮後、ろ過して澄明なる液100mlを得た。

【0017】次に、本発明の白髪防止剤の実施例並びにその白髪防止効果の試験例を挙げる。

#### 【0018】

##### 【実施例】

#### 処方例1 (トリートメントオイル)

ホホバ油20.0g、ミンク油20.0g、黄れんのエタノール抽出物1.0g、香料 微量にスクワランを加え全量を100gとし、これを均一に攪拌し容器に充填して製品とする。

#### 【0019】処方例2 (ヘヤークリーム)

ポリオキシエチレンベヘニルエーテル(20E.O.) 2.0g、テトラオレイン酸ポリオキシエチレンソルビット(40E.O.) 1.0g、親油型モノステアリン酸グリセリン2.0g、サラシミツロウ3.0g、マイクロクリスタリンワックス5.0g、ベヘニルアルコール1.3g、流動パラフィン20.0g、オクタン酸セチル10.0g、黄れんの水抽出物1.0g及びパラオキシ安息香酸ブチル0.1gを均一に混合し、加温溶解しA液とする。

【0020】パラオキシ安息香酸メチル0.1g、1、

3-ブチレングリコール5.0g及び精製水50.5gを加え加温溶解しB液とする。

【0021】A液にB液を加え攪拌し乳化した後冷却する。この液に香料を微量加え攪拌混合し、冷却して容器に充填して製品とする。

#### 【0022】処方例3 (ヘヤーニック)

1、3-ブチレングリコール3.0g、イソプロピルメチルフェノール0.05g、香料 微量、エタノール55.0g、塩化ベルベリン1.0gに精製水40.93gを均一に攪拌し容器に充填して製品とする。

#### 【0023】試験例

##### (1) B16細胞によるメラニン生成亢進試験

##### a) 試験方法

マウスメラノーマ由来B16細胞 $4 \times 10^4$ 個を10%牛胎児血清10mlを含んだイーグルMEM培地に懸濁し、 $25\text{cm}^2$ 培養用ルー瓶にて5%CO<sub>2</sub>存在下37℃で培養する。0日目及び3日目に供試試料(表1に記載した添加量)を含む培地で交換し、5日間培養する。細胞を0.8W/V食塩を含有するリン酸緩衝液(pH7.2)で洗浄後、トリプシン及びEDTA含有溶液を使用して剥離し、遠心により細胞を回収した。回収された細胞のメラニン定量をIt<sub>o</sub>法により行った。

##### 【0024】b) 供試試料

- ① オウレンのエタノール抽出液(No. 1)
- ② オウレンの水抽出液(No. 2)
- ③ 塩化ベルベリン(No. 3)

##### c) 試験結果

次の表1の通り、試料No. 1~3はコントロールに対し、明らかにメラニン生成亢進作用が認められた。

#### 【0025】

【表1】

試料No.	添加量	メラニン量 ( $\mu\text{g}/10^5$ セル)
コントロール	無添加	2.10
1	20 $\mu\text{l}$ 50	3.09 3.34
2	5 $\mu\text{l}$ 10 20	2.73 3.55 4.77
3	2 $\mu\text{g}$ 5	2.47 3.21

#### 【0026】(2) ヒトによる白髪防止試験

##### a) 試験方法

白髪の認められる35~60才の男7名、女3名の被検者に下記の供試剤を1回約1.5ml、1日2回(朝、

夕)頭皮に塗擦した。塗擦前及び塗擦6ヵ月後における頭頂部の毛髪1,000本当たりの白髪の本数を数えた。

##### 【0027】b) 供試剤

塩化ベルベリン 1 %  
 95 %エタノール 50 %  
 グリセリン 5 %  
 精製水 44 % (％は重量％である)

c) 試験結果  
 次の表2の通りであった。  
 【0028】  
 【表2】

被検者 No	白髪本数	
	使用前	使用6ヶ月後
1	58	33
2	126	56
3	101	98
4	92	73
5	374	200
6	82	56
7	238	133
8	190	95
9	96	62
10	37	23

【0029】

【発明の効果】本発明によれば、頭皮や毛髪に湿疹やか

ぶれなどの障害を与えることなく、白髪発生防止効果の  
 すぐれた白髪防止剤を提供することができる。